### (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



# 

### (43) 国際公開日 2005 年7 月14 日 (14.07.2005)

PCT

## (10) 国際公開番号 WO 2005/063704 A1

(51) 国際特許分類?: C07D 205/04, 491/113, 403/04, 409/12, 403/12, 405/12, 401/12, 409/12, A61K 31/4427, 31/397, 31/496, A61P 9/12, 9/10, 9/00, 11/06, 11/00, 43/00, 3/10, 3/06, 13/12

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/019400

(22) 国際出願日:

2004年12月24日(24.12.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ: 特願 2003-429948

2003年12月25日(25.12.2003) J

- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 小野薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5418526 大阪府大阪市中央区道修町二丁目 1 番 5 号 Osaka (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 巾下 広 (HABASHITA, Hiromu) [JP/JP]; 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 倉田 晴登 (KURATA, Haruto) [JP/JP]; 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 中出 眞嗣 (NAKADE, Shinji) [JP/JP]; 〒3004247 茨城県つくば市和台 1 7 番地 2 小野薬品工業株式会社内 [baraki (JP). 小野 岳児 (ONO, Takeji) [JP/JP]; 〒3004247 茨城県つくば市和台 1 7 番地 2 小野薬品工業株式会社内 [baraki (JP).

- (74) 代理人: 岩谷 龍 (IWATANI, Ryo); 〒5300003 大阪府 大阪市北区堂島 2 丁目 1番31号 ORIX堂島ビル3階 Osaka (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DB, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FL, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, D, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### 規則4.17に規定する申立て:

— AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO 特許 (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY,

[続葉有]

(54) Title: AZETIDINE RING COMPOUNDS AND DRUGS COMPRISING THE SAME

(54) 発明の名称: アゼチジン環化合物およびその医薬

(57) Abstract: It is intended to provide compounds having EDG-5 antagonism. Because of having EDG-5 antagonism, compounds represented by the following general formula (I): (I) wherein each symbol is as defined in the description; salts thereof, N-oxide derivatives thereof, solvates of the same or prodrugs of the same are useful as preventives and/or remedies for EDG-5-mediated diseases for example, diseases caused by blood vessel contraction (for example, cerebrovascular spasms disease, cardiovascu-

lar spasms diseases, coronary artery spasms disease, hypertension, pulmonary hypertension, renal diseases, myocardial infarction, angina, arrhythmia, portal hypertension, varicosity, etc.), arteriosclerosis, pulmonary fibrosis, hepatic fibrosis, renal fibrosis, respiratory diseases (for example, bronchial asthma, chronic obstructive pulmonary disease, etc.), nephropathy, diabetes, hyperlipemia and so on.

♥ (57) 要約: EDG-5 拮抗作用を有する化合物を提供すること。 一般式(I) 【化 1】 (式中、全ての記号は明知書記載の通り。)で示される化合物、その塩、そのN-オキシド体もしくはその溶媒和物、またはそれらのプロドラッグはEDG-5 拮抗作用を有するので、EDG-5 介在性疾患、例えば、血管の収縮に起因する疾患(例えば、脳血管攣縮性疾患、心血管攣縮性疾患、冠動脈攣縮性疾患、高血圧、肺高血圧、腎疾患、心筋梗塞、狭心症、不整脈、門脈圧亢進症または静脈瘤等)、動脈硬化症、肺線維症、肝線維症、腎線維症、呼吸器系疾患(例えば、気管支喘息、慢性閉塞性肺疾患等)、腎症、糖尿病または高脂血症等の予防および/または治療剤として有用である。